

# TRAITE DE COOPERATION EN MATIERE DE BREVETS

107/507281

Rec'd PCT 10 SEP 2004

PCT

## RAPPORT D'EXAMEN PRELIMINAIRE INTERNATIONAL

(article 36 et règle 70 du PCT)

REC'D 09 JUN 2004

WIPO PCT



Référence du dossier du déposant ou du mandataire	<b>POUR SUITE A DONNER</b> voir la notification de transmission du rapport d'examen préliminaire international (formulaire PCT/PEA/416)	
Demande internationale No. PCT/FR 03/00797	Date du dépôt international (jour/mois/année) 12.03.2003	Date de priorité (jour/mois/année) 12.03.2002
Classification internationale des brevets (CIB) ou à la fois classification nationale et CIB A61K9/06, A61K9/06		
Déposant ETHYPHARM et al.		

1. Le présent rapport d'examen préliminaire international, établi par l'administration chargée de l'examen préliminaire international, est transmis au déposant conformément à l'article 36.
2. Ce RAPPORT comprend 5 feuilles, y compris la présente feuille de couverture.
  - ☒ Il est accompagné d'ANNEXES, c'est-à-dire de feuilles de la description, des revendications ou des dessins qui ont été modifiées et qui servent de base au présent rapport ou de feuilles contenant des rectifications faites auprès de l'administration chargée de l'examen préliminaire international (voir la règle 70.16 et l'instruction 607 des Instructions administratives du PCT).

Ces annexes comprennent 2 feuilles.

3. Le présent rapport contient des indications et les pages correspondantes relatives aux points suivants :

- I ☒ Base de l'opinion
- II ☐ Priorité
- III ☐ Absence de formulation d'opinion quant à la nouveauté, l'activité inventive et la possibilité d'application industrielle
- IV ☐ Absence d'unité de l'invention
- V ☒ Déclaration motivée selon la règle 66.2(a)(ii) quant à la nouveauté, l'activité inventive et la possibilité d'application industrielle; citations et explications à l'appui de cette déclaration
- VI ☐ Certains documents cités
- VII ☐ Irrégularités dans la demande internationale
- VIII ☐ Observations relatives à la demande internationale

Date de présentation de la demande d'examen préliminaire internationale 10.10.2003	Date d'achèvement du présent rapport 08.06.2004
Nom et adresse postale de l'administration chargée de l'examen préliminaire international  Office européen des brevets D-80298 Munich Tél. +49 89 2399 - 0 Tx: 523656 epmu d Fax: +49 89 2399 - 4465	Fonctionnaire autorisé Rauter, A N° de téléphone +49 89 2399-8645 

PCT/FR 03/00797

**RAPPORT D'EXAMEN  
PRÉLIMINAIRE INTERNATIONAL**

Demande internationale n°

PCT/FR 03/00797

5. ☐ Le présent rapport a été formulé abstraction faite (de certaines) des modifications, qui ont été considérées comme allant au-delà de l'exposé de l'invention tel qu'il a été déposé, comme il est indiqué ci-après (règle 70.2(c)) :

*(Toute feuille de remplacement comportant des modifications de cette nature doit être indiquée au point 1 et annexée au présent rapport.)*

6. Observations complémentaires, le cas échéant :

**V. Déclaration motivée selon l'article 35(2) quant à la nouveauté, l'activité inventive et la possibilité d'application industrielle; citations et explications à l'appui de cette déclaration**

1. Déclaration

Nouveauté	Oui:	Revendications	5,10,12,14,17-19
	Non:	Revendications	1-4,6-9,11,13,15,16,20-25
Activité inventive	Oui:	Revendications	
	Non:	Revendications	1-25
Possibilité d'application industrielle	Oui:	Revendications	1-25
	Non:	Revendications	

2. Citations et explications

**voir feuille séparée**

**POINT V. ....**

1. La présente notification fait mention des documents suivants cités dans le rapport de recherche:

D1: WO-A-9 956 725

D2: WO-A-9 913 913

D3: EP-A-1 063 007

D4: Journal of Pharmaceutical Sciences, Vol. 88, No. 6, June 1999,  
pages 608-614

D5: FR-A-2 281 162

D6: Chem. Commun., 2001, 1556-1557

D7: Chem. Commun., 2001, 185-186

2. La présente demande ne remplit pas les conditions énoncées à l'article 33(2) PCT, l'objet des revendications indépendantes 1, 20, 21, 23 et 24 n'étant pas nouveau (voir règle 64(1)-(3) PCT).

D1 (voir par exemple revendications 1; 2, 3, 7; page 4, ligne 1 - page 5, ligne 10; page 6, ligne 21-27) se réfère déjà à une composition comprenant un liquide organique hydrophobe, une substance organogélatrice comme définie et une substance bioactive; la composition passe sous forme d'organogel lorsqu'elle entre en contact avec un liquide aqueux. Pour le manque de la nouveauté de l'utilisation et des procédés de préparations comme revendiqué voir les revendications 11 et 14; page 6, lignes 28-38; ainsi que exemples.

L'objection de manque de nouveauté peut aussi se baser sur les documents suivants:

~~D2: voir p.ex. page 6, ligne 12 - page 4, ligne 18;~~

D3: voir p.ex. exemple 1.

Les revendications dépendantes 2-19, 22 et 25 ne contiennent aucune caractéristique qui, en combinaison avec celles de l'une quelconque des revendications à laquelle elles se réfèrent, définisse un objet qui satisfasse aux exigences du PCT en ce qui concerne la nouveauté et/ou l'activité inventive et ce car les liquides organiques, les substances organogélatrices et les substances bioactives spécifiées sont mentionnés dans D1 (voir p.ex. page 4, ligne 15 - page 5, ligne 32; revendications 1-3, 7; 12; exemples). Les documents D4 - D7 sont très

pertinents en particulier pour le jugement d'une activité inventive pour les revendications dépendantes.

présentant des extrémités acide, alcool ou amine, notamment un dérivé d'acides aminés.

17. Composition selon la revendication 16, caractérisée en ce que la substance organogélatrice appartient au groupe des dérivés esters de l'alanine.

- 5 18. Composition selon la revendication 17, caractérisée en ce que ladite substance organogélatrice est le N-lauroyl L-alanine méthyle ester ou N-lauroyl L-alanine éthyle ester.

- 10 19. Composition selon la revendication 17, caractérisée en ce que ladite substance organogélatrice est le N-stéaroyl L-alanine méthyle ester ou le N-stéaroyl L-alanine éthyle ester.

20. Organogel obtenu à partir de la composition selon l'une des revendications 1 à 18, caractérisé en ce qu'il reste sous forme gélifiée stable entre la température d'application et la température de transition gel/liquide de ladite composition.

- 15 21. Utilisation d'une composition selon l'une des revendications 1 à 20 pour la fabrication d'un médicament destiné à être injecté dans l'organisme par voie parentérale extravasculaire et notamment par voie sous cutanée, intradermique, intrapéritonéale ou intramusculaire, ou destiné à être administré par voie intra-oculaire ou par voie vaginale, sur une plaie ouverte ou lors d'une  
20 intervention chirurgicale.

22. Utilisation d'une composition selon l'une des revendications 1 à 20 pour la fabrication d'un médicament destiné à être utilisé comme vecteur de libération prolongée de substance(s) bioactive(s) dans l'organisme.

- 25 ~~23. Procédé de préparation d'une composition selon la revendication 1,~~  
caractérisé en ce que la substance bioactive, éventuellement en solution aqueuse, est ajoutée au mélange constitué de la substance organogélatrice et du solvant organique hydrophobe.

24. Procédé de préparation d'une composition selon la revendication 3 qui consiste à

- 30 - dissoudre la substance organogélatrice dans le solvant organique hydrophile, puis à incorporer la substance bioactive et le solvant organique hydrophobe.

25. Procédé selon la revendication 24, caractérisé en ce que lorsque la substance bioactive est peu soluble ou pas soluble dans la phase organique, une solution aqueuse de ladite substance est dispersée sous agitation dans la phase organique constituée de la substance organogélatrice et du solvant
- 5 organique hydrophile.
-

10/507,281

PCT/FR2003/000797

PATENT COOPERATION TREATY



PCT/FR2003/000797 10 SEP 2004

## INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

(PCT Article 36 and Rule 70)

Applicant's or agent's file reference	<b>FOR FURTHER ACTION</b> See Notification of Transmittal of International Preliminary Examination Report (Form PCT/IPEA/416)	
International application No. PCT/FR2003/000797	International filing date (day/month/year) 12 mars 2003 (12.03.2003)	Priority date (day/month/year) 12 mars 2002 (12.03.2002)
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC A61K 9/06, A61K9/06		
Applicant ETHYPHARM		

1. This international preliminary examination report has been prepared by this International Preliminary Examining Authority and is transmitted to the applicant according to Article 36.

2. This REPORT consists of a total of 5 sheets, including this cover sheet.

☒ This report is also accompanied by ANNEXES, i.e., sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis for this report and/or sheets containing rectifications made before this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions under the PCT).

These annexes consist of a total of 2 sheets.

3. This report contains indications relating to the following items:

- I ☒ Basis of the report
- II ☐ Priority
- III ☐ Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability
- IV ☐ Lack of unity of invention
- V ☒ Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement
- VI ☐ Certain documents cited
- VII ☐ Certain defects in the international application
- VIII ☐ Certain observations on the international application

Date of submission of the demand 10 octobre 2003 (10.10.2003)	Date of completion of this report 21 October 2004 (21.10.2004)
Name and mailing address of the IPEA/EP	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.



# INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/FR2003/000797

## I. Basis of the report

1. This report has been drawn on the basis of *(Replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to the report since they do not contain amendments.)*:

☐ the international application as originally filed.

☒ the description, pages 1-25, as originally filed,  
pages \_\_\_\_\_, filed with the demand,  
pages \_\_\_\_\_, filed with the letter of \_\_\_\_\_,  
pages \_\_\_\_\_, filed with the letter of \_\_\_\_\_.

☒ the claims, Nos. 1-15, 16 (partially), as originally filed,  
Nos. 16 (partially), 17-25, as amended under Article 19,  
Nos. \_\_\_\_\_, filed with the demand,  
Nos. \_\_\_\_\_, filed with the letter of \_\_\_\_\_,  
Nos. \_\_\_\_\_, filed with the letter of \_\_\_\_\_.

☒ the drawings, sheets/fig 1/9-9/9, as originally filed,  
sheets/fig \_\_\_\_\_, filed with the demand,  
sheets/fig \_\_\_\_\_, filed with the letter of \_\_\_\_\_,  
sheets/fig \_\_\_\_\_, filed with the letter of \_\_\_\_\_.

2. The amendments have resulted in the cancellation of:

☐ the description, pages \_\_\_\_\_

☐ the claims, Nos. \_\_\_\_\_

☐ the drawings, sheets/fig \_\_\_\_\_

3. ☐ This report has been established as if (some of) the amendments had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).

4. Additional observations, if necessary:

## INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/FR 03/00797

**V. Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement****1. Statement**

Novelty (N)	Claims	5, 10, 12, 14, 17-19	YES
	Claims	1-4, 6-9, 11, 13, 15, 16, 20-25	NO
Inventive step (IS)	Claims		YES
	Claims	1-25	NO
Industrial applicability (IA)	Claims	1-25	YES
	Claims		NO

**2. Citations and explanations**

1. This report refers to the following search report citations:

D1: WO-A-9 956 725

D2: WO-A-9 913 913

D3: EP-A-1 063 007

D4: Journal of Pharmaceutical Sciences, Vol. 88,  
No. 6, June 1999, pages 608-614

D5: FR-A-2 281 162

D6: Chem. Commun., 2001, 1556-1557

D7: Chem. Commun., 2001, 185-186

2. The present application does not meet the requirements of PCT Article 33(2) since the subject matter of independent claims 1, 20, 21, 23 and 24 is not novel (PCT Rule 64.1 to 64.3).

D1 (see, for example, claims 1, 2, 3 and 7; page 4, line 1, to page 5, line 10; page 6, lines 21 to 27) already refers to a composition comprising a hydrophobic organic liquid, an organogelling substance as defined and a bioactive substance; the composition changes into the form of an organogel when it comes into contact with an aqueous liquid.

Concerning the lack of novelty of the use and preparatory methods as claimed, see claims 11 and 14, page 6, lines 28 to 38, and the examples.

The objection for lack of novelty can also be based on the following documents:

D2: see, for example, page 6, line 12, to page 4, line 18;

D3: see, for example, example 1.

Dependent claims 2 to 19, 22 and 25 do not contain any features which, combined with those of any of the claims to which they refer, define subject matter which might meet the PCT novelty and/or inventive step requirements, since the organic liquids, organogelling substances and bioactive substances specified are mentioned in D1 (see, for example, page 4, line 15, to page 5, line 32; claims 1 to 3, 7 and 12; examples). Documents D4 to D7 are highly relevant, in particular to the assessment of inventive step of the dependent claims.